

# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/EP05/001320

International filing date: 10 February 2005 (10.02.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: DE  
Number: 10 2004 007 076.8  
Filing date: 13 February 2004 (13.02.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 16 March 2005 (16.03.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland  
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

**BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND****Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung****Aktenzeichen:**

10 2004 007 076.8

**Anmeldetag:**

13. Februar 2004

**Anmelder/Inhaber:**

BAYER CropScience AG, 40789 Monheim/DE

**Bezeichnung:**

Imidazolopyrimidine

**IPC:**

C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 30. November 2004  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
**Der Präsident**

Im Auftrag

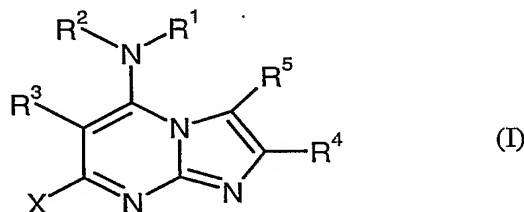
Imidazolopyrimidine

Die Erfindung betrifft Imidazolopyrimidine, ein Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte Imidazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen  
5 (siehe z.B. WO-A 03/022 850).

Da sich aber die ökologischen und ökonomischen Anforderungen an moderne Fungizide laufend erhöhen, beispielsweise was Wirkspektrum, Toxizität, Selektivität, Aufwandmenge, Rückstandsbildung und günstige Herstellbarkeit angeht, und außerdem z.B. Probleme mit Resistenzen auftreten können, besteht die ständige Aufgabe, neue Fungizide zu entwickeln, die zumindest in Teil-  
10 bereichen Vorteile gegenüber den bekannten aufweisen.

Es wurden nun neue Imidazolopyrimidine der Formel (I),



in welcher

$R^1$  für H,  $R^2$ , gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl,  
15 gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder für  
gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht;

$R^2$  für einen organischen Rest steht, der 3 bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere  
Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Hetero-  
atome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder sub-  
20 stituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene; oder

$R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls  
substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält  
und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist;

$R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gege-  
25 benenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls sub-  
stituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes

Aralkyl, Halogen, eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Arylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio steht;

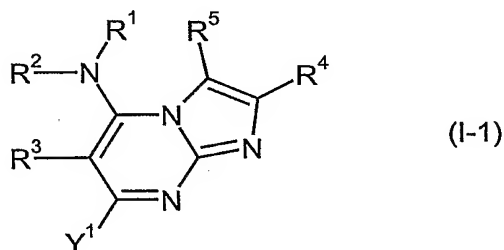
R<sup>4</sup> für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht;

10 R<sup>5</sup> für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht; und

X für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht;

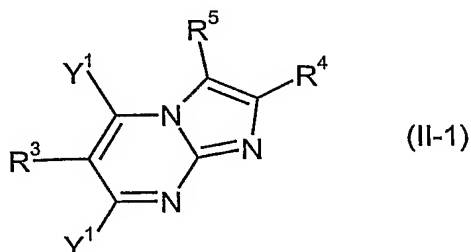
sowie deren Salze, gefunden.

15 Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-1),



die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass X für Y<sup>1</sup> = Halogen steht, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (a) Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-1),



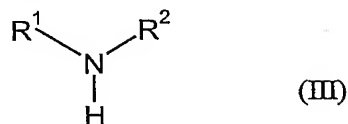
20

in welcher

$R^3, R^4, R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für Halogen steht,

EINBETTEN mit Aminen der Formel (III),

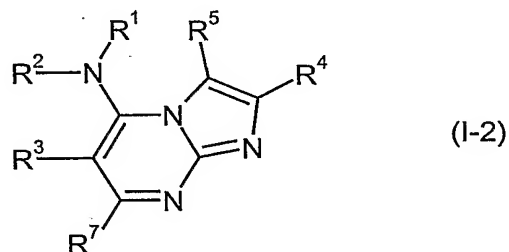


5 in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-2),

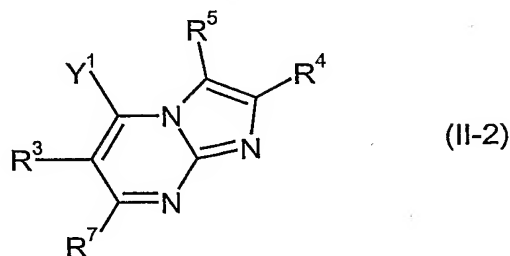


10

die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass X für  $R^7$  steht, wobei  $R^7$  gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl bedeutet, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (b)

15 Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-2),



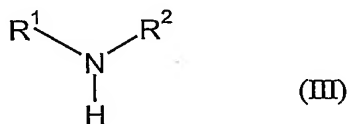
in welcher

$R^3, R^4, R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für Halogen und

$R^7$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

mit Aminen der Formel (III),



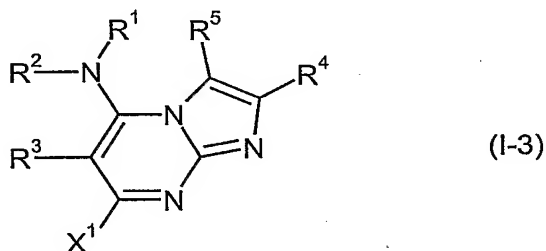
5

in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt.

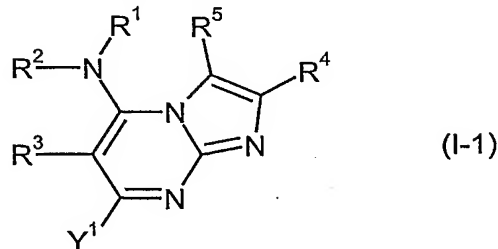
10 Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-3),



die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass X für  $X^1 = \text{Cyano}$  oder gegebenenfalls substituiertes Alkoxy steht, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (c)

15 die bereits genannten Imidazolopyrimidine der Formel (I-1)



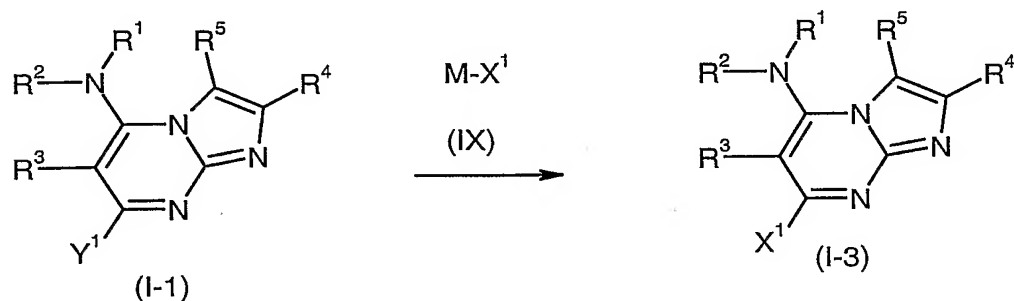
in Analogie zu WO-A 02/083677 mit einer

Verbindung der Formel  $M-X^1$  (IX),

in der das Kation M z.B. Ammonium, Tetraalkylammonium, ein Alkalimetall, wie Lithium, Natrium oder Kalium, oder ein Erdalkalimetall, wie Magnesium, bedeutet und in der

$X^1$  Cyano, Alkoxy oder substituiertes Alkoxy, wie Halogenalkoxy, bedeutet,

umsetzt:



Schließlich wurde gefunden, dass sich die Imidazolopyrimidine der Formel (I) sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, wie R- und S-Isomeren oder Atropisomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen.

Die erfindungsgemäßen Imidazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

- 15 a<sup>1</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Aryl, oder
- a<sup>2</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, oder
- a<sup>3</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, oder
- a<sup>4</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, oder
- a<sup>5</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, oder
- 20 a<sup>6</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, oder
- a<sup>7</sup>)  $R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, oder
- a<sup>8</sup>)  $R^3$  für eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe steht.

Ebenso bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen  $R^3$  eine der folgenden Bedeutungen hat:

- b<sup>1</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>,
- b<sup>2</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>8</sup>,
- 5 b<sup>3</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>4</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>5</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>6</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>7</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- 10 b<sup>8</sup>: a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>.

Weiterhin bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen ein oder mehrere Symbole eine der im folgenden angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

- R<sup>1</sup> für H steht, oder
- R<sup>1</sup> für einen Rest R<sup>2</sup> steht, oder
- 15 R<sup>1</sup> für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- R<sup>1</sup> für Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis  
20 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- R<sup>1</sup> für Alkynyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- 25 R<sup>1</sup> für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder



- R<sup>1</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel, steht, wobei das Heterocyclyl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen,
- 5 R<sup>2</sup> für eine aliphatische, gesättigte oder ungesättigte Gruppe mit 1 bis 13 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Siliziumatomen steht, die gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthält und die unsubstituiert oder durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert ist, oder
- 10 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring mit 3 bis 8 Ringgliedern stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste R<sup>2</sup> substituiert ist, wobei der Heterocyclus ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglied enthalten kann und wobei der Heterocyclus weiterhin bis zu dreifach substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor- und/oder Chloratomen,
- 15 R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkyl steht, wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert ist und/oder gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe R<sup>x</sup> trägt, oder C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkyl, das gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe R<sup>x</sup> trägt, und R<sup>x</sup> Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkenoxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyloxy bedeutet,
- 20 R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;
- 25 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- 30

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5      jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

10      jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen;

15      in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

oder

20      R<sup>3</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei das Heterocyclyl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano, Nitro und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

oder

25      R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkenylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Arylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino oder Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino;

30

R<sup>4</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl;

5 R<sup>5</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl; und

X für H, Fluor, Chlor, Brom oder CN steht.

Besonders bevorzugt sind diejenigen Imidazolopyrimidine der Formel (I), in denen ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten besonders bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

10 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;

R<sup>2</sup> für eine Gruppe Y<sup>2</sup>-Si(O<sub>m</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>p</sub>Y<sup>3</sup>),

wobei m, n und p unabhängig voneinander 0 oder 1;

15 Y<sup>2</sup> eine Bindung oder Alkandiyl, Alkendiyl oder Alkindiyl, die jeweils geradkettig oder verzweigt sind, 1 bis 6, bzw. 2 bis 6 Kohlenstoffatome aufweisen, gegebenenfalls durch ein oder zwei nicht benachbarte Sauerstoffatome unterbrochen und unsubstituiert oder durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert sind; und

20 Y<sup>3</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit 1 bis 5 bzw. 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch ein Sauerstoff-Stickstoff- oder Schwefelatom unterbrochen und unsubstituiert oder durch 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert, bedeuten;

R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, Benzyl oder

25 R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluor-

- 5 ethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- für in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl,
- 10 R<sup>3</sup> für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 15 R<sup>3</sup> für Pyrimidyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 20 R<sup>3</sup> für Thienyl, das in 2- oder 3-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, oder
- 25 R<sup>3</sup> für Thiazolyl, das in 2-, 4- oder 5-Stellung verknüpft ist und einfach bis zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 30 R<sup>3</sup> für N-Piperidiny, N-Tetrazolyl, N-Pyrazolyl, N-Imidazolyl, N-1,2,4-Triazolyl, N-Pyrrolyl, oder N-Morpholiny, die jeweils unsubstituiert oder ein- oder - falls möglich - mehrfach gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl substituiert sind,

R<sup>4</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl;

R<sup>5</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl; und

X für H, F, Cl, CN, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl

5 steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten ganz besonders bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

R<sup>1</sup> für H;

10 R<sup>2</sup> für SiMe<sub>3</sub>, SiMe<sub>2</sub>Et, SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>,  
SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeSiMe<sub>3</sub>, CHMeSiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
15 (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me, CHMeCH<sub>2</sub>-  
SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CFMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>-  
SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
20 CHMeCHMeSiMe<sub>3</sub>, CMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>Si-  
Me<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et,  
CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>-  
CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CMe=CHSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, -C≡C-SiMe<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C≡C-  
SiMe<sub>3</sub> oder -CHMe-C≡C-SiMe<sub>3</sub>;

25 R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-6)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, wobei R<sup>3</sup>  
unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiert ist,

oder

R<sup>3</sup> für 2,4- oder 2,6-disubstituiertes Phenyl, oder für 2-substituiertes Phenyl oder für 2,4,6-  
trisubstituiertes Phenyl,

$R^3$  für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

5  $R^3$  für Pyrimidyl, das in 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl;

$R^4$  für H,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ , Cl oder Cyclopropyl;

10  $R^5$  für H,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ , Cl oder Cyclopropyl; und

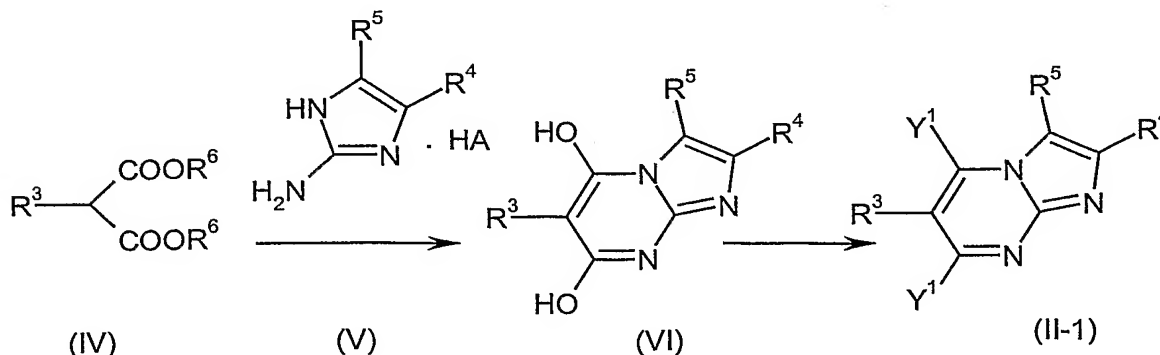
X für Fluor, Chlor,  $(\text{C}_1\text{-C}_7)\text{-Alkyl}$  oder  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-Haloalkyl}$  steht.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

15 Die als Ausgangsstoffe eingesetzten Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-1) und der Formel (II-2) lassen sich analog zu den in der WO-A 03/022850 angegebenen Herstellungsverfahren durch Verfahren (d) und Verfahren (e) synthetisieren:

Verfahren (d):

Dieses bekannte Verfahren dient zur Herstellung von Ausgangsstoffen (II-1), die nach dem oben stehenden Verfahren (a) zu den Imidazolopyrimidinen der Formel (I-1) umgesetzt werden können,

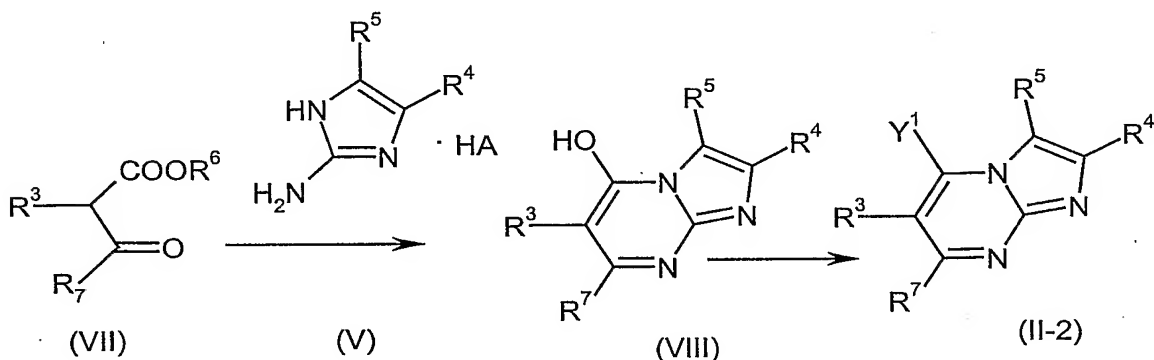


20

wobei die Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Verfahren (e):

Dieses bekannte Verfahren dient zur Herstellung der Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-2), die nach dem oben stehenden Verfahren (b) zu den Imidazolopyrimidinen der Formel (I-2) umgesetzt werden können,

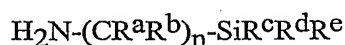


wobei die Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Die weiterhin zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für  $R^1$  und  $R^2$  als bevorzugt angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind bekannt. Sie sind teilweise käuflich erhältlich oder lassen sich nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden herstellen.

So sind silylierte Amine der Formel (IIIa),

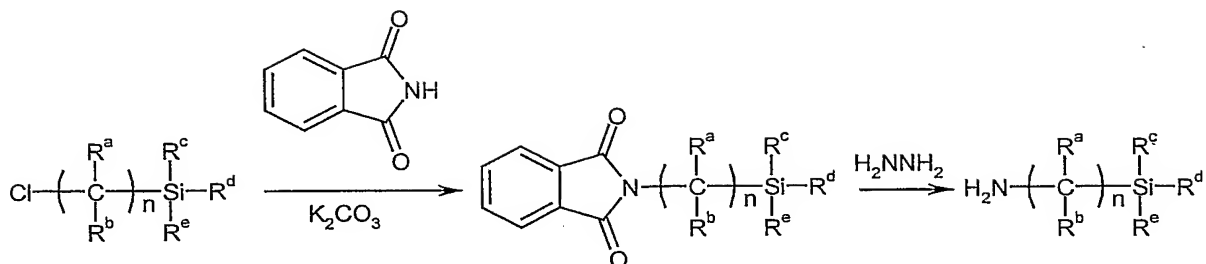


15 worin

n eine natürliche Zahl von 0 bis 10 und

$R^a, R^b, R^c, R^d$  gleich oder verschieden H,  $CH_3$  oder  $C_2H_5$  bedeuten (wobei die Gesamtzahl der C-Atome in  $R^a-d \leq 12$  ist),

allgemein zugänglich, indem man beispielsweise Phthalimid in Gegenwart einer Base, wie  $K_2CO_3$ , mit einem Halogenalkylsilan umsetzt und das entstandene N-substituierte Phthalimid mit Hydrazin spaltet:



Solche Synthesen sind beispielsweise beschrieben in J. Am. Chem. Soc. 1951, 73, 5130 oder J. Organomet. Chem. 1978, 174, C18.

- 5 Haloalkylsilane sind käuflich oder können nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden hergestellt werden (siehe z.B. Houben-Weyl, Band 13/5, S. 65 ff. oder Science of Synthesis, Vol. 4, S. 247 ff.).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) werden im Allgemeinen unter Atmosphärendruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

- 10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril  
15 oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

- Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b)  
20 alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithium-diisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat,  
25 Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylamino-



pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise  
5 verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallacetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin,  
10 N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) und (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Fluoride, wie Natriumfluorid, Kaliumfluorid oder Ammoniumfluorid.

15 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II-I) bzw. (II-2) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise  
20 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II-I) bzw. (II-2) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an M-X<sup>1</sup> der Formel (IX) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

25 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich im Pflanzenschutz beispielsweise zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und  
30 Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz beispielsweise zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 5 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;  
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;  
Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;  
Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;  
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;
- 10 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;  
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;  
Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;  
Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;
- 15 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;  
Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;  
Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;  
Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;  
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea
- 20 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);  
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus  
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);  
Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;  
Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
- 25 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;  
Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;  
Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;  
Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;  
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;
- 30 Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;  
Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;  
Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;  
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;  
Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
- 35 Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

- 5 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

- 10 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

- 15 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

- 20 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Erysiphe-Arten, von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia-, Sphaerotheca- und Podosphaera-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

- 25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

- 30 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsme-

thoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützba- ren oder nicht schützba- ren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, Holzverfärbende und Holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,  
Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,  
Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,  
Coniophora, wie *Coniophora puetana*,  
5 Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,  
Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,  
Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,  
Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,  
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,  
10 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,  
Escherichia, wie *Escherichia coli*,  
Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,  
Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

- Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen  
15 Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

- Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen  
20 und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische  
25 Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol, sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssig-  
30 keiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie  
35

Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel, wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe, wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau, und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe, und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink, verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

#### **Fungizide:**

25 2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat;

Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprime; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin;

Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin;

Calcium-polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram;

- 5 Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflumentorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon;

Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole;

- 10 Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenciclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Fumecyclox;

- 15 Guazatine;

Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol;

Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione;

Kasugamycin; Kresoxim-methyl;

- 20 Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin;

Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol;

Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin;

- 25 Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine;

Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene;

Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur;

Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen;  
Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid;  
Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamid; Tricyclazole; Tridemorph;  
5 Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole;

Uniconazole;

Validamycin A; Vinclozolin;

Zineb; Ziram; Zoxamide;

10 (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid;

1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion;

2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin;

2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid;

2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide;

15 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril;

Actinovate;

cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol;

Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat;

Monokaliumcarbonat;

20 N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid;

Natriumtetrathiocarbonat;

sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfer-naphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.



**Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oethilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**5 Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflomet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin,

- 10 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin,
- 15 Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben,

- Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr,
- 20 Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer),
- 25 Cyromazine,

DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439,

- 30 Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoazole, Etrimfos,

- Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocycithrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb,
- 5      Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren,
- Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene,
- 10      IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,
- Japonilure,
- Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene,
- Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,
- 15      Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800,
- 20      Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron,
- OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl,
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet,
- 25      Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- Quinalphos,

Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,

S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,

Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Traloccythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

10 Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, Xylcarb,

ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,

15 die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbammat (Tsumacide Z),

die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923),

20 sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden, oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safenern bzw. Semiochemicals ist möglich.

25 Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphase Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die

Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche  
5 Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

- 10 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vor-  
15 zugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

- Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle  
20 biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“  
25 wurde oben erläutert.

- Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen,  
30 Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwand-

- mengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der
- 5 Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

- Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation
- 10 genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert
- 15 der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kultur-
- 20 pflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine,
- 25 insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR),
- 30 Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander
- 35 in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen

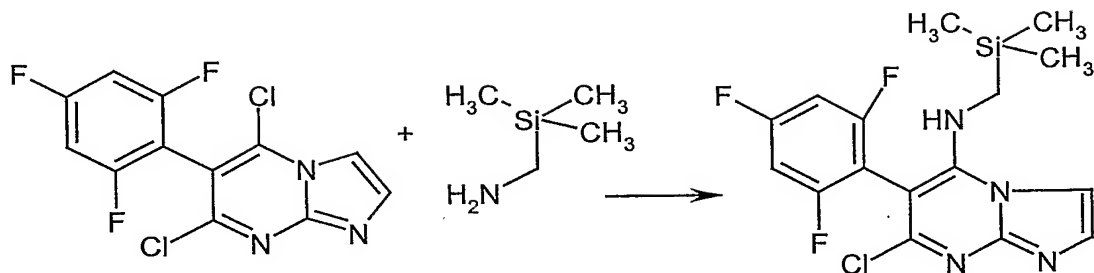
YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

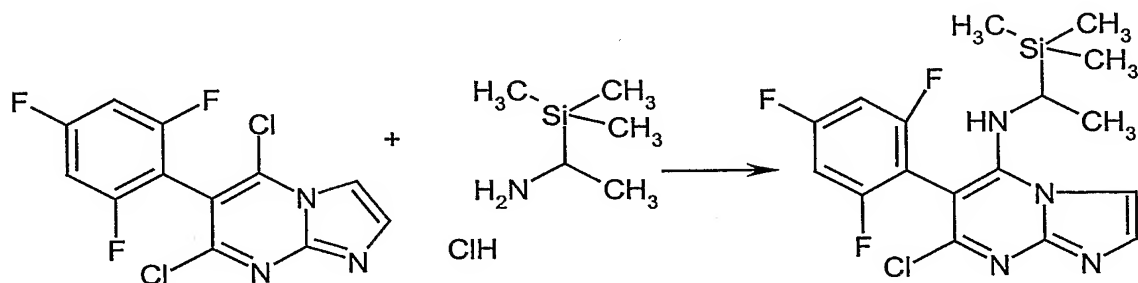
Weiterhin eignen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zur Unterdrückung des Wachstums von Tumorzellen in Menschen und Säugetieren. Dies basiert auf einer Wechselwirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen mit Tubulin und Mikrotubuli und durch Förderung der Mikrotubuli-Polymerisation.

Zu diesem Zweck kann man eine wirksame Menge an einer oder mehreren Verbindungen der Formel (I) oder pharmazeutisch verträglicher Salze davon verabreichen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

**Beispiele****Beispiel 1**

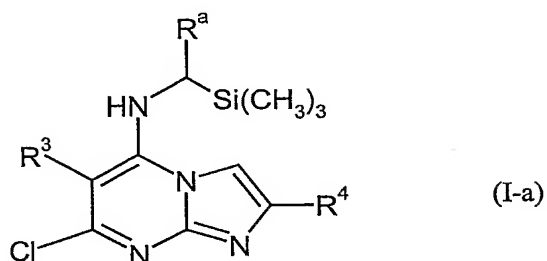
- 0,5 g (0,002 Mol) 6-(2,4,6-Trifluorphenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin wurden in 7,8 g  
 5 Acetonitril vorgelegt. Bei Raumtemperatur wurden 0,326 g(0,002 Mol) Kaliumcarbonat und  
 0,162 g (0,002 Mol) Trimethylsilylmethylamin zugegeben und 16 Stunden nachgerührt. Das Reak-  
 tionsgemisch wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die organische  
 Phase wurde getrocknet und eingengt. Der Rückstand wurde mit Diethylether verrührt, abgesaugt  
 und getrocknet. Man erhielt 0,2 g 5-Chlor-6-(2,4,6-Trifluorphenyl)-7-trimethylsilylmethylamino-  
 10 imidazo[1,2-a]pyrimidin (log p = 2,09; HPLC-Gehalt 98,6 %)

**Beispiel 2**

- 0,5 g (0,002 Mol) 6-(2,4,6-Trifluorphenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin wurden in 7,8 g  
 Acetonitril vorgelegt. Bei Raumtemperatur wurden 0,543 g(0,004 Mol) Kaliumcarbonat und  
 15 0,242 g (0,002 Mol) 2-Trimethylsilyl-1-aminoethan zugegeben und 16 Stunden nachgerührt. Das  
 Reaktionsgemisch wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die orga-  
 nische Phase wurde getrocknet und eingengt und dann in Cyclohexan : Essigsäureethylester = 1 :  
 1 auf Kieselgel chromatographiert. Man erhielt 0,3 g 5-Chlor-6-(2,4,6-Trifluorphenyl)-7-(1-  
 trimethylsilylethylamino)-imidazo[1,2-a]pyrimidin (log p = 2,18; HPLC-Gehalt 87,4 %)

- 20 Die Verbindung 6-(2,4,6-Trifluorphenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin ist bekannt aus  
 WO-A 03/022 850 und aus WO-A 03/089 433.

Analog zu den zuvor angegebenen Methoden werden bzw. wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I-a) erhalten.

**Tabelle 1**

| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>                         | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|--|----------------|------|----------|
| 1        | H               | 2,4,6-Trifluorophenyl                  | H              | 2,09 |          |
| 2        | CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl                  | H              | 2,18 |          |
| 3        | H               | 2-Cl-4-F-phenyl                        | H              | 2,20 |          |
| 4        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-4-F-phenyl                        | H              | 2,38 |          |
| 5        | H               | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 6        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 7        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-Phenyl                            | H              |      |          |
| 8        | H               | 3-Cl-5-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl | H              |      |          |
| 9        | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl                     | H              |      |          |
| 10       | CH <sub>3</sub> | 3-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl      | H              |      |          |
| 11       | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 12       | H               | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 13       | H               | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |
| 14       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |
| 15       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |
| 16       | H               | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |
| 17       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |
| 18       | H               | 2,5-Difluorophenyl                     | H              |      |          |



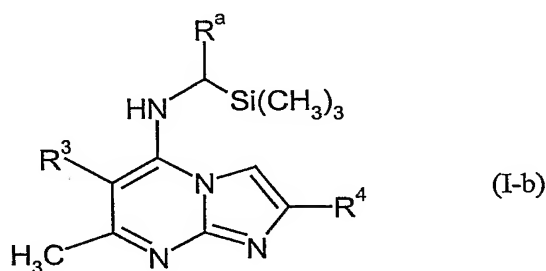
| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|---|----------------|------|----------|
| 19       | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 20       | H               | 2-Cl-Phenyl   | H              |      |          |
| 21       | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-Phenyl   | H              |      |          |
| 22       | H               | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 23       | CH <sub>3</sub> | 5-Cl-Pyrimidin-4-yl   | H              |      |          |
| 24       | H               | 5-Cl-Pyrimidin-4-yl   | H              |      |          |
| 25       | CH <sub>3</sub> | sec-Butyl   | H              |      |          |
| 26       | H               | sec-Butyl   | H              |      |          |
| 27       | H               | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 28       | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 29       | H               | N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)   | H              |      |          |
| 30       | CH <sub>3</sub> | N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)   | H              |      |          |
| 31       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -) | H              |      |          |
| 32       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -) | H              |      |          |
| 33       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)                | H              |      |          |
| 34       | CH <sub>3</sub> | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)                | H              |      |          |
| 35       | H               | 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl  | H              |      |          |
| 36       | CH <sub>3</sub> | 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl  | H              |      |          |
| 37       | H               | N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )   | H              |      |          |
| 38       | CH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )   | H              |      |          |
| 39       | H               | 3-Thienyl   | H              |      |          |
| 40       | CH <sub>3</sub> | 3-Thienyl   | H              |      |          |
| 41       | H               | 3-F-Phenylthio  | H              |      |          |
| 42       | CH <sub>3</sub> | 3-F-Phenylthio  | H              |      |          |
| 43       | H               | 3-Cl-Phenylthio   | H              |      |          |
| 44       | CH <sub>3</sub> | 3-Cl-Phenylthio   | H              |      |          |

| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>              | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|-----------------------------|----------------|------|----------|
| 45       | H               | 3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>  | H              |      |          |
| 46       | CH <sub>3</sub> | 3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>  | H              |      |          |
| 47       | H               | 3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub> | H              |      |          |
| 48       | CH <sub>3</sub> | 3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub> | H              |      |          |

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure.

- 5 Analog zu den zuvor angegebenen Methoden werden bzw. wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (I-b) erhalten.

**Tabelle 2**



| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>                         | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|--|----------------|------|----------|
| 1        | H               | 2,4,6-Trifluorophenyl                  | H              |      |          |
| 2        | CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl                  | H              |      |          |
| 3        | H               | 2-Cl-4-F-phenyl                        | H              |      |          |
| 4        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-4-F-phenyl                        | H              |      |          |
| 5        | H               | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 6        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-6-F-Phenyl                        | H              |      |          |
| 7        | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-Phenyl                            | H              |      |          |
| 8        | H               | 3-Cl-5-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl | H              |      |          |
| 9        | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl                     | H              |      |          |

| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|---|----------------|------|----------|
| 10       | CH <sub>3</sub> | 3-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl   | H              |      |          |
| 11       | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-6-F-Phenyl   | H              |      |          |
| 12       | H               | 2-Cl-6-F-Phenyl   | H              |      |          |
| 13       | H               | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 14       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 15       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 16       | H               | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 17       | CH <sub>3</sub> | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 18       | H               | 2,5-Difluorphenyl   | H              |      |          |
| 19       | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 20       | H               | 2-Cl-Phenyl   | H              |      |          |
| 21       | CH <sub>3</sub> | 2-Cl-Phenyl   | H              |      |          |
| 22       | H               | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 23       | CH <sub>3</sub> | 5-Cl-Pyrimidin-4-yl   | H              |      |          |
| 24       | H               | 5-Cl-Pyrimidin-4-yl   | H              |      |          |
| 25       | CH <sub>3</sub> | sec-Butyl   | H              |      |          |
| 26       | H               | sec-Butyl   | H              |      |          |
| 27       | H               | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 28       | CH <sub>3</sub> | 5-F-Pyrimidin-4-yl  | H              |      |          |
| 29       | H               | N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)   | H              |      |          |
| 30       | CH <sub>3</sub> | N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)   | H              |      |          |
| 31       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -) | H              |      |          |
| 32       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -) | H              |      |          |
| 33       | H               | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)                | H              |      |          |
| 34       | CH <sub>3</sub> | N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)                | H              |      |          |
| 35       | H               | 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl  | H              |      |          |

| Bsp. Nr. | R <sup>a</sup>  | R <sup>3</sup>                                      | R <sup>4</sup> | logP | Fp. (°C) |
|----------|-----------------|---|----------------|------|----------|
| 36       | CH <sub>3</sub> | 3,5-Dimethylpyrazol-1-yl                            | H              |      |          |
| 37       | H               | N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) | H              |      |          |
| 38       | CH <sub>3</sub> | N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) | H              |      |          |
| 39       | H               | 3-Thienyl   | H              |      |          |
| 40       | CH <sub>3</sub> | 3-Thienyl   | H              |      |          |
| 41       | H               | 3-F-Phenylthio                                      | H              |      |          |
| 42       | CH <sub>3</sub> | 3-F-Phenylthio                                      | H              |      |          |
| 43       | H               | 3-Cl-Phenylthio                                     | H              |      |          |
| 44       | CH <sub>3</sub> | 3-Cl-Phenylthio                                     | H              |      |          |
| 45       | H               | 3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>                          | H              |      |          |
| 46       | CH <sub>3</sub> | 3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>                          | H              |      |          |
| 47       | H               | 3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>                         | H              |      |          |
| 48       | CH <sub>3</sub> | 3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>                         | H              |      |          |

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure.

### Verwendungsbeispiele

#### Beispiel A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

- |   |                 |   |
|---|-----------------|---|
|   | Lösungsmittel : | 24,5 Gewichtsteile Aceton                 |
| 5 |                 | 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid       |
|   | Emulgator :     | 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether |

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauenerregers *Podosphaera leucotricha* inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70% aufgestellt.
- 15 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigen ein oder mehrere der erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel :                    24,5 Gewichtsteile Aceton  
   24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5    Emulgator :                    1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10    Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

15    Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90% aufgestellt.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

20    In diesem Test zeigen ein oder mehrere der erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Beispiel C

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Lösungsmittel :                    24,5 Gewichtsteile Aceton  
   24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5    Emulgator :                    1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10    Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

15    2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigen ein oder mehrere der erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Beispiel D

Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Lösungsmittel:            49 Gewichtsteile            N, N - Dimethylformamid

Emulgator:            1 Gewichtsteil            Alkylarylpolglykolether

- 5    Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 10    Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

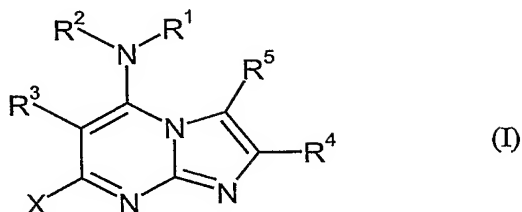
- 15    7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Bei diesem Test zeigen ein oder mehrere der erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 750 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.



**Patentansprüche**

1. Imidazolopyrimidine der Formel (I),



in welcher

- 5       $R^1$       für H,  $R^2$ , gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht,
- 10       $R^2$       für einen organischen Rest steht, der 3 bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder substituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene, oder
- 15       $R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist,
- 20       $R^3$       für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, Halogen, oder gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Arylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyloxy, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyloxy, gegebenenfalls substituiertes C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio;
- 25

R<sup>4</sup> für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht;

R<sup>5</sup> für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht; und

5 X für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

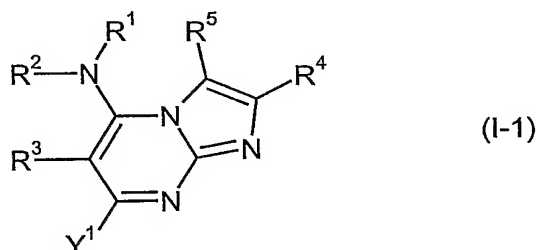
sowie deren Salze.

2. Verfahren zur Herstellung von Imidazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, wobei

10

(Verfahren (a))

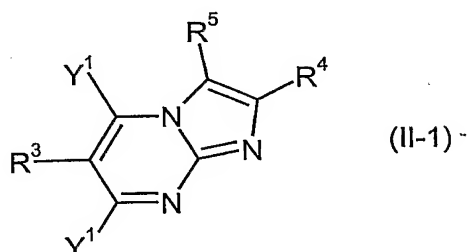
Imidazolopyrimidine der Formel (I-1), in denen Y<sup>1</sup> für Halogen steht,



und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15

durch Umsetzung von Halogenimidazolopyrimidinen der Formel (II-1),

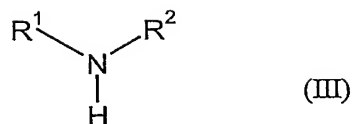


in welcher

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen steht,

mit Aminen der Formel (III),



in welcher

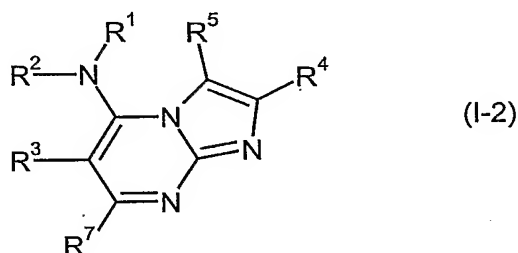
$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenfalls in Gegenwart eines Katalysators erhält,

oder

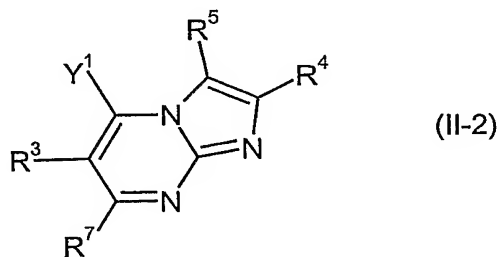
(Verfahren (b))

10 Imidazolopyrimidine der Formel (I-2), in denen  $R^7$  für gegebenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenfalls substituiertes Phenyl steht,



und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

durch Umsetzung von Halogenimidazolopyrimidinen der Formel (II-2),



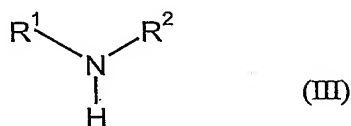
15

in welcher

$R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen und R<sup>7</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

mit Aminen der Formel (III),



5 in welcher

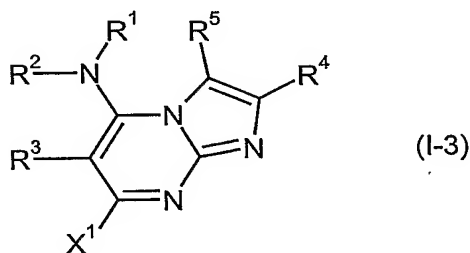
R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators erhält,

oder

10 (Verfahren (c))

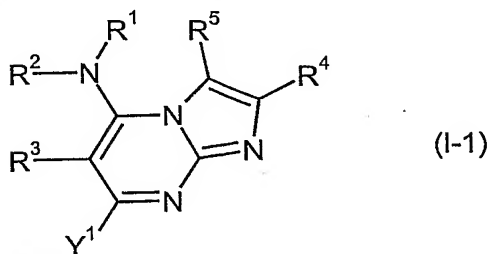
Imidazolopyrimidine der Formel (I-3), in denen X<sup>1</sup> für Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Alkoxy steht,



und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15

aus den oben genannten Imidazolopyrimidine der Formel (I-1),



wobei  $Y^1$  für Halogen steht und die übrigen Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben,

durch Umsetzung mit einer

Verbindung der Formel  $M-X^1$  (IX),

5 in der das Kation M Ammonium, Tetraalkylammonium, ein Alkalimetall oder ein Erdalkalimetall bedeutet, und in der

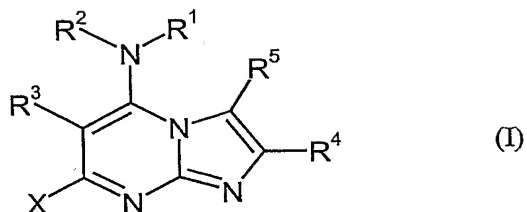
$X^1$  Cyano, Alkoxy oder substituiertes Alkoxy bedeutet, erhält.

- 10 3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Imidazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
4. Verwendung von Imidazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.
- 15 5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

**Imidazolopyrimidine**

## Zusammenfassung

Imidazolopyrimidine der Formel



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ , und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

ein Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.